

XP-002200998

AN - 1966-11971F [00]

CPY - TEIK

DC - B00

FS - CPI

MC - B01-A03 B12-L05

M5 - [01] S001 S003 S005 S502 S503 S617 S702 S703 S802 S803 T502 T517 T717
S030 S033 S050 S132 S133 S134 S142 S143 S730 S735 S736 S830 T531 T534
T536 U500 U501 P930 Q252 M900

PA - (TEIK) TEIKOKU HORMONE MFG CO LTD

PN - JP39005480B B 00000000 DW196800 000pp

PR - JP19610009885 19610325

AB - J64005480 The following process and compounds (II) and (III) produced
thereby:-

- (III) where R1 = H, lower alkyl or acyl

- R2 = lower alkyl

- Process is specifically described for:

- R1 = H R2 = CH3

- H C2H5

- Compounds have hair growth promoting activity with weak side-effects
such as female hormone activity.

IW - OESTRANE DERIVATIVE

IKW - OESTRANE DERIVATIVE

NC - 001

OPD - 1961-03-25

ORD - 1900-00-00

PAW - (TEIK) TEIKOKU HORMONE MFG CO LTD

TI - Oestrane derivs

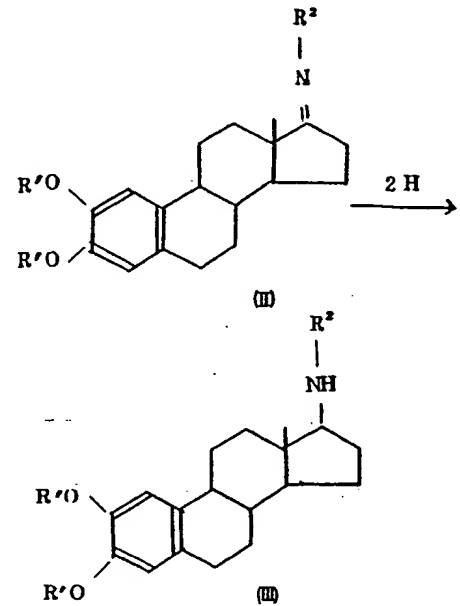
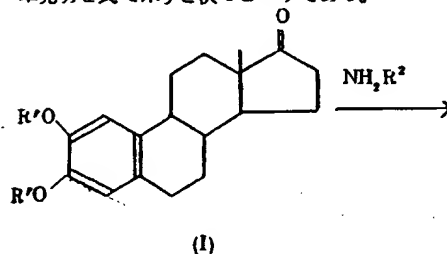
エストラン誘導体の製造法

特 願 昭 36-9885
出 願 日 昭 36. 3.25
発 明 者 山本俊平
京都市右京区聖護院川原町53京都大学
医学部附属病院内
同 松原忠世
同 所
同 鈴木安司
同 所
同 横浜市鶴見区下野谷町1の13鶴見化学
研究所内
同 中馬一操
同 所
出 願 人 帝國機器製薬株式会社
東京都港区赤坂溜池町20東邦ビルデ
ィング
代 表 者 山口栄一
代 理 人 弁理士 小林正雄

発明の詳細な説明

本発明は新規なる17-アルキルイミノ-または17-アルキルアミノ-エストラン誘導体の製造法に関する。本発明によればエストロンのA環に2個の水酸基を有する17-ケート化合物またはその水酸基における誘導体(I)を原料とし、これにアルキルアミン(アルキル基は低級アルキル基である)を縮合させることにより、17-アルキルイミノ-エストラン誘導体(II)が製造される。またかくして得られる17-アルキルイミノ化合物を還元することにより、17-アルキルアミノ-エストラン誘導体(III)が製造される。

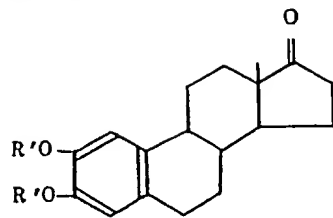
本発明を式で示すと次のとおりである。



式中R'は水素原子、低級アルキル基またはアシル基を、R²は低級アルキル基を表わし、低級アルキル基とはメチル、エチル、プロピル、ブチル等の基を意味する。

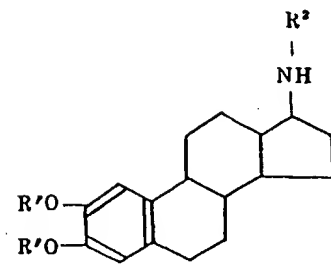
本発明の実施方法について説明すると、例えば2-ニトロエストロンより製造される1・3・5(10)-エストラトリエン-2・3-ジオール-17-オン原料としこの17-ケートン体(I)に低級アルキルアミン例えばメチルアミンまたはエチルアミンを作用させると17-アルキルイミノ体(II)を生成する。このイミノ化の際液状のアミンはそのまま使用できるが、メチルアミンのごとき常温で気体のまたは気体になりやすいアミン即ち沸点の低いアミン類を使用する場合は、加圧容器中で液化した状態で原料の17-ケートン体(I)と反応させることが適当である。またこのイミノ化の際アミンを不活性の有機溶媒例えばエタノール、ベンゼン等に冷時吸収せしめて使用し、あるいは不活性の有機溶媒中でアミンを飽和水溶液として使用し反応に供することができる。またアルキルアミンの塩例えば塩酸塩と塩基例えば炭酸カリウムにより反応時遊離のアルキルアミンを発生させながらイミノ化を行うこともできる。R'がアシル基の場合はこの反応に際し通常は脱アシル化も行われる。反応は室温またはそれ以上の温度にて行うのが普通である。さらに触媒として例えば塩化アンモニウム、塩化カルシウム等を用い

2 次の一般式



(式中R'は水素原子、低級アルキル基またはアシル基を表わす)を有する17-ケートーエストラン誘導体に一般式 NH_2R^2 (R^2 は低級アルキル基を表わす)を有するアルキルアミンを作用させて相当する17-アルキルイミノ-エストラン誘導体を生成させ、次いでこれを常法に従つてステロイドのA環を還元しないような還元万

法によつて、還元することを特徴とする次の一般式



(式中R'およびR²は前記と同じものを表わす)を有する17-アルキルアミノ-エストラン誘導体の製法。